

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19)世界知的所有権機関  
国際事務局



(43)国際公開日  
2005年9月1日 (01.09.2005)

PCT

(10)国際公開番号  
WO 2005/080392 A1

(51)国際特許分類<sup>7</sup>: C07D 471/04, A61K 31/4745,  
31/5377, 31/496, A61P 43/00, 35/00, 19/10

(21)国際出願番号: PCT/JP2005/003086

(22)国際出願日: 2005年2月18日 (18.02.2005)

(25)国際出願の言語: 日本語

(26)国際公開の言語: 日本語

(30)優先権データ:  
特願2004-042491 2004年2月19日 (19.02.2004) JP

(71)出願人(米国を除く全ての指定国について): 武田  
薬品工業株式会社 (TAKEDA PHARMACEUTICAL  
COMPANY LIMITED) [JP/JP]; 〒5410045 大阪府大阪  
市中央区道修町四丁目1番1号 Osaka (JP).

(72)発明者: および  
(75)発明者/出願人(米国についてのみ): 福本 正司 (FUKU-  
MOTO, Shoji) [JP/JP]; 〒5328686 大阪府大阪市淀川  
区十三本町二丁目17番85号 武田薬品工業株式  
会社内 Osaka (JP). 山本 武志 (YAMAMOTO, Takeshi)  
[JP/JP]; 〒5328686 大阪府大阪市淀川区十三本町二

丁目17番85号 武田薬品工業株式会社内 Os-  
aka (JP). 岡庭 正格 (OKANIWA, Masanori) [JP/JP]; 〒  
5328686 大阪府大阪市淀川区十三本町二丁目17番  
85号 武田薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 田中 稔  
祐 (TANAKA, Toshimasa) [JP/JP]; 〒5328686 大阪府大  
阪市淀川区十三本町二丁目17番85号 武田薬品  
工業株式会社内 Osaka (JP).

(74)代理人: 高島 一 (TAKASHIMA, Hajime); 〒5410044  
大阪府大阪市中央区伏見町四丁目1番1号 明治安  
田生命大阪御堂筋ビル Osaka (JP).

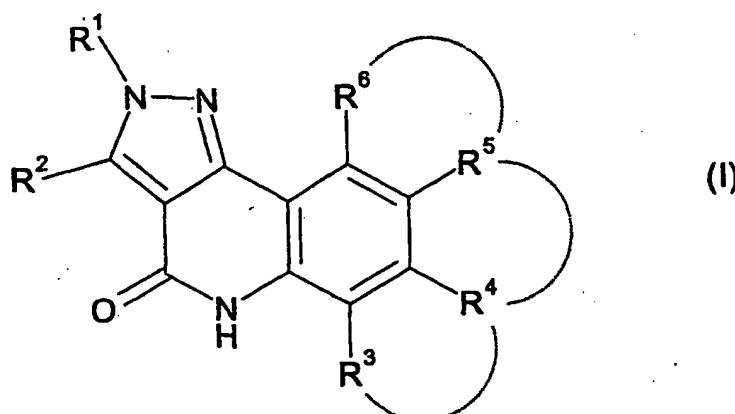
(81)指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が  
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,  
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,  
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,  
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,  
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,  
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,  
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,  
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84)指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護  
が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA,  
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ,  
BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE,

/締葉有)

(54) Title: PYRAZOLOQUINOLONE DERIVATIVE AND USE THEREOF

(54)発明の名称: ピラゾロキノロン誘導体およびその用途



WO 2005/080392 A1

(57) Abstract: A pyrazoloquinolone derivative having kinase inhibitory activity. It is a compound represented by the formula (I) [wherein R<sup>1</sup> represents optionally substituted aryl or optionally substituted aromatic heterocyclic group; R<sup>2</sup> represents hydrogen, optionally substituted amino, optionally substituted hydroxy, or optionally substituted thiol; and R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, and R<sup>6</sup> are the same or different and each represents (1) hydrogen, (2) nitro, (3) cyano, (4) halogeno, (5) an optionally substituted hydrocarbon group, (6) optionally substituted amino, (7) optionally substituted hydroxy, or (8) optionally substituted thiol, provided that R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, and R<sup>5</sup> may be bonded respectively to R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, and R<sup>6</sup> to form a ring in cooperation with the adjacent carbon atoms] or a salt of the compound.

/締葉有)

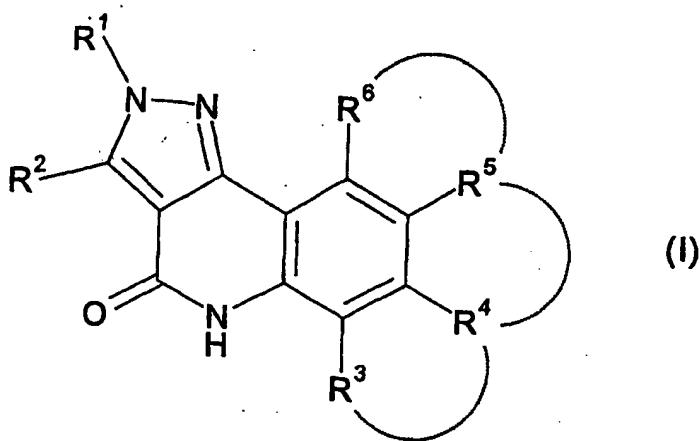
BEST AVAILABLE COPY

BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG). 2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイドスノート」を参照。

添付公開書類:  
— 國際調査報告書

## (57) 要約:

キナーゼ阻害作用を有するピラゾロキノロン誘導体を提供する。式



〔式中、R<sup>1</sup> は置換基を有していてもよいアリール基または置換基を有していてもよい芳香族複素環基；R<sup>2</sup> は水素原子、置換基を有していてもよいアミノ基、置換基を有していてもよいヒドロキシ基または置換基を有していてもよいチオール基；R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> は同一または異なって、(1)水素原子、(2)ニトロ基、(3)シアノ基、(4)ハロゲン基、(5)置換基を有していてもよい炭化水素基、(6)置換基を有していてもよいアミノ基、(7)置換基を有していてもよいヒドロキシ基または(8)置換基を有していてもよいチオール基を示す。また、R<sup>3</sup> と R<sup>1</sup>、R<sup>4</sup> と R<sup>5</sup>、および R<sup>5</sup> と R<sup>6</sup> は隣接する炭素原子とともに環を形成してもよい。〕で表される化合物またはその塩。